



## PATENT ABSTRACTS OF JAPAN

(11) Publication number: **58222004 A**(43) Date of publication of application: **23 . 12 . 83**

(51) Int. Cl

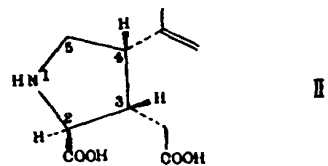
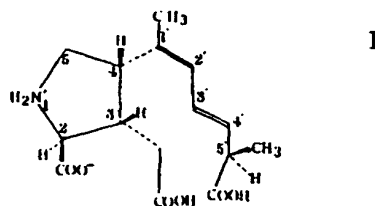
**A01N 43/36**(21) Application number: **57105201**(22) Date of filing: **17 . 06 . 82**(71) Applicant: **SUNTORY LTD**(72) Inventor: **TANAKA TAKAHARU  
NOMOTO KIYOSUKE  
FUJITA TOSHIO**(54) **INSECTICIDE**

COPYRIGHT: (C)1983,JPO&amp;Japio

(57) Abstract:

**PURPOSE:** An insecticide that contains domoic acid as an active ingredient, thus showing high insecticidal effects against sanitarly harmful insects such as flies or cockroaches by acting on nerval synapses without limitation on application places and times with high safety, because of this low toxicity and stability to heat and light.

**CONSTITUTION:** The objective insecticide contains, as an active ingredient, domoic acid, (2S, 3S, 4S)-2-carboxy-4-(1-methyl-5-carboxy-1Z,3E-hexadienyl)pyrrolidine-3-acetic acid of formula I. The compound of formula I is isolated from HANAYANAGI (*Chordria armata* Okamura, Rhodomelaceae), having anthelmintic activity similar to kainic acid of formula II and giving an expectation of physiological activity in regard of nerval transmission. The compound can be given directly, however, it is prepared by using dilutents and additives preferably. Satisfactory effects are obtained, when it is applied in a concentration of 0.01W0.2% in the form of a dust, solution or aerosol.



⑬ 日本国特許庁 (JP)  
 ⑭ 公開特許公報 (A)

⑪ 特許出願公開

昭58—222004

⑫ Int. Cl.<sup>3</sup>  
 A 01 N 43/36

識別記号

庁内整理番号  
 7055—4H

⑬ 公開 昭和58年(1983)12月23日

発明の数 1  
 審査請求 未請求

(全 4 頁)

⑯ 殺虫剤

⑰ 特 願 昭57—105201  
 ⑱ 出 願 昭57(1982)6月17日  
 ⑲ 発 明 者 田中隆治  
 大阪市東淀川区東淡路町1丁目  
 5番1号801  
 ⑳ 発 明 者 野本享資

英本市若園町15番9号  
 ⑲ 発 明 者 藤田稔夫  
 京都市左京区岩倉三宅町38番地  
 の1  
 ⑲ 出 願 人 サントリー株式会社  
 大阪市北区堂島浜2丁目1番40  
 号  
 ㉑ 代 理 人 弁理士 門脇清

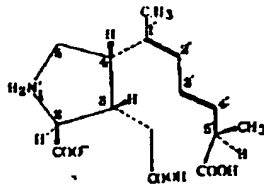
明 細 書

1. 発明の名称

殺 虫 剤

2. 特許請求の範囲

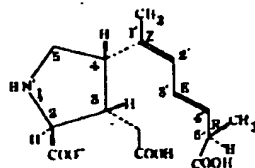
(I) 式



にて表わされるドウセイ酸を有効成分とする  
 殺虫剤。

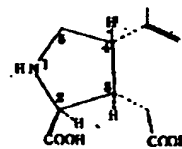
3. 発明の詳細な説明

本発明は下式(I)で示されるドウセイ酸を有効  
 成分とする殺虫剤に関する。



(II)

下式(III)で示されるカイニン酸 (Kainic acid  
 又は digenic acid ; 2-カルボキシ-4-イソ  
 プロペニルピロリジン-3-酢酸) は、1958年  
 村上らによりカイニンソウ (Digenea simplex  
 C. Agardh) から分離された薬虫成分である。

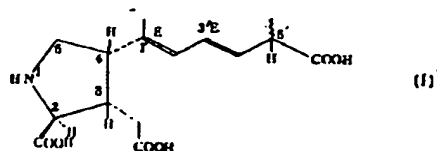


(III)

そして本物質は、近年中枢神経系における神経  
 伝達性を示す事実が明らかとなり注目を浴びて  
 いる。

一方、前記式(II)で示したドウセイ酸 (Domoic  
 acid ; (2S,3R,4R) - 2-カルボキシ-4-(1-  
 ノルチル-5-カルボキシ-12,3E-ヘキサジ  
 エニル)ピロリジン-3-酢酸) は、磯崎、竹本  
 らによりフジマツモ科ハナヤナギ (Chondriaorma  
 ta (Kützting) Okamura, Rhodomelaceae) から分  
 離され (微生物誌, 29, 353, 356 (1959年))、そ

の後、竹本等により構造式(下式(II'))が提出されたが(薬学雑誌, 35, 874(1986年))、近年に至り、竹本、野本らによるX線解析等の結果、上記式(II)のC-4位に1'2, 3'Eジエンの側鎖を持ち、C-5'位の絶対配置がRである絶対構造が確定されたものである。



この化合物(II)は、カイニン酸と同様に駆虫作用を持ち、かつ神経伝達作用の点でも従来以上の生体活性が期待されているが、その他の作用に関しては全く未知であった。

しかるに、本発明者らは研究の結果、本化合物(II)が、寄生害虫、例えばハエ、ゴキブリ等に対し卓越した殺虫効果を有し、しかもその殺虫作用の機序が従来のピレスロイド系殺虫剤等における中枢神経作用と異なり、神経筋接合部

に作用するという、新しい機構に基づくものであることを見出した。

本発明に係る化合物(II)は、温血動物に対する毒性が極小で、その上、魚類に対しても極めて低毒性であるから、実用上極めて安全な殺虫剤となりうる。しかも熱、光等に対しても安定であって、使用の場所、時期等に制限を受けないという特徴がある。

本発明に係る化合物(II)は、そのままでも使用できるが、或るべく、使用場所、使用目的等に応じ種々の補助剤、例えば粘着剤、緩衝剤、乳化剤、分散剤、潤滑剤、共力剤等を添加されるのが好ましい。さらに目的によっては、他の配合成分のない殺虫剤、誘引剤、殺菌剤、除草剤、植物栄養剤、肥料、芳香剤及び噴射剤等を併用することもできる。

本発明の実施に当り、適当な化合物(II)の濃度は状況により広範囲に互い変化する。しかし一般的には0.01~0.2%の範囲で適用すると、概ね満足すべき結果を示す。以下実験例、実施例及び

処方例を挙げ発明を詳細に説明するが、もちろん例示は単に説明用のものであって、発明精神の限定を意図するものではない。

#### 実験例(ゴキブリの腸管収縮試験)

ワモンゴキブリ(*Periplaneta americana*)の腹部を切開して腸管に附属している組織を実体顕微鏡下に除去し、アルビノー氏管接合部位より肛門に至る後腸部分を採取した。この腸管を154mM NaCl、27mM KCl、22mM グルコース及び1.8mM  $\text{CuCl}_2 \cdot 2\text{H}_2\text{O}$  から成る栄養液(pH6.8)中に吊るし、25℃に保温して化合物(II)及びグルタミン酸(対照)を投与した。結果を下表-1に示す。表の如く、化合物(II)は対照のグルタミン酸に比しより低濃度で大きな収縮力を示す。なお、ゴキブリの中枢神経系に対しては、本化合物は100ppm以上の濃度でも影響を及ぼさなかった。

表 - 1

試 薬	濃 度 (ppm)	収 縮 長 (mm)
グルタミン酸	40	0.64
	20	0.28
化 合 物 (II)	25	0.74
	5	0.38
	1	0.00

#### 実施例1(各種ゴキブリに対する注射法による効力試験)

ワモンゴキブリ(学名前出)、クロゴキブリ(*P. fuliginosa*)及びヤマトゴキブリ(*P. japonica*)の各虫体の腹部第3~第4節に、水で稀釈した化合物(II)各1.0~1.0mgをマイクロシリンジを用いて注射した。供試虫体は各濃度につき20匹であった。注射後24時間通常の方法で飼育し、24時間後に効果を判定した。結果を下表-2として示す。

表 - 2

投与量(mg)	殺 死 率 (%)		
	ワモンゴキブリ	ヤマトゴキブリ	クロゴキブリ
10	100	100	100
1	100	100	100
0.8	100	100	100
0.4	50	50	50
0.0(水)	0	0	0

(対照)

上表の示す如く、本化合物(II)はゴキブリの中枢神経系を問わず、強力な致死効果を示し、その最小

有効濃度は  $1.3 \times 10^{-8}$  mole である。因みに、市販の殺虫用の最小有効濃度は、フェノスリン (phenothrin)  $3.2 \times 10^{-10}$  mole、アレスリン (Allethrin)  $3.2 \times 10^{-10}$  mole、D D T  $7.4 \times 10^{-8}$  mole であって、本化合物 (I) が、ピレスロイドにやや及ばないまでも強力な殺虫作用を有する事実が実証された。

実施例 2 (チャバネゴキブリに対する滴下法による効力試験)

チャバネゴキブリ (*Blattella germanica*) の成虫を炭酸ガスで麻酔し、各虫体の胸面腹部に水で所定濃度に稀釈した化合物 (I) の溶液 1.0  $\mu$ l をマイクロシリンジを用いて滴下させた。供試虫体数は 1 濃度当り 50 匹ずつであった。滴下後 24 時間通常の方法で飼育し、直ちにその生死をもって効果を判定した。結果を下表 - 3 として示す。

表 - 3

投与量 (ppm)	致死率 (%)
10	100
5	100
2.5	100
1.0	80
0.5	60
0.25	10
0.05 (水)	0 (対照)

上表の結果から、本化合物 (I) のチャバネゴキブリに対する  $LD_{50}$  値は約 0.5 ppm 匹で、市販のフェニトロチロン、パーノスリン又はアー BHC (γ-ベンゼン) と同程度の強い接触毒性を有する。

実施例 3 (イエバエに対する滴下法による効力試験)

炭酸ガスで麻酔させたイエバエ (*Musca domestica*) の成虫の胸面腹部に、所定濃度に稀釈された化合物 (I) の水溶液を実施例 2 と同様滴下し、24 時間後に効果を判定した。結果を下表 - 4 に示す。表から見えるように、本化合物 (I) は、イエバエに対してはゴキブリ類に対するよりも一層強力で、0.2 ppm 匹の投与で 50% 以上の致死率を示す。なお、本例でも 1 濃度当り 50 匹の成虫を供試した。

表 - 4

投与量 (ppm)	致死率 (%)
1	100
0.3	100
0.1	40
0.05	0
0.0 (水)	0 (対照)

#### 1. 処方例 1

##### (1) 粉 剤

化合物 (I) 1 g、ピペロニルブトキシサイド (共力剤) 10 g 及びバスター剤で密着されたタルク 989 g を攪拌機でよく混合し、ゴキブリ用粉米殺虫剤 1000 g を得る。本殺虫剤は、直接虫体に散布する以外に、ゴキブリの通路に散布しても強力な接触毒性を示す。

##### (2) 液 剤

化合物 (I) 1 g 及びポリオキシエチレン・ノニル・フェニルエーテル 10 g を水 1000 ml 中に溶解し、これにピペロニルブトキシサイド 10 g を加えホモキサー中で均質に混合分散させ、ハエ及びゴキブリ用殺虫剤 1000 ml を得る。

##### (3) 噴射剤

化合物 (I) 1 g、ポリオキシエチレン・ノニル・フェニルエーテル 10 g、ピペロニルブトキシサイド 10 g 及びデキストリン 20 g を 50% エタノール水 1000 ml と共にホモキサー中で攪拌

乳化させ、これを各 100 ml 容のエアゾール容器に分注後、加圧炭酸ガスを圧入し、ハエ及びゴキブリ用エアゾール製剤を得る。

特許出願人 サントリー株式会社  
代 理 人 弁理士 門 脇

## 手続補正書(自発)

昭和57年6月19日

特許庁長官 島田 春樹 殿

## 1. 事件の表示

昭和57年6月17日出願の特許願  
明 細 書

57-105201

## 2. 発明の名称 殺虫剤

## 3. 補正をする者

事件との関係 特許出願人

住 所 大阪市北区堂島浜2丁目1番40号  
代 理 人 (名称) サントリー株式会社

代表者 佐治 敬三

## 4. 代 理 人

住 所 大阪市東淀川区東三田1-32-12リビース新館室606号  
氏 名 芥屋士(6294) 門 脇 昭 雄

## 5. 補正命令の日付 なし

## 6. 補正により増加する発明の数 0

## 7. 補正の対象 明細書の「発明の名称」の項

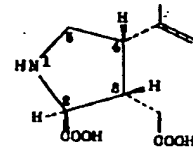
## 8. 補正の内容 別紙のとおり。

## 9. 添付書類の日録 (1) 別紙

特許庁  
57.6.21昭和57年6月21日  
特許庁

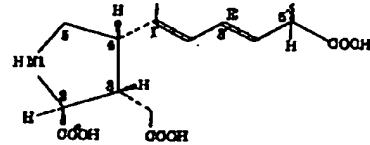
## 8 補正の内容

(1) 明細書、2頁、式(II)を以下のとおりに改める。



(II)

(2) 同、3頁、式(I)を以下のとおりに改める。



(I)

特許法第17条の2の規定による補正の掲載

昭和 57 年特許願第 105201 号 (特開昭  
58-222004 号; 昭和 58 年 12 月 23 日  
発行 公開特許公報 58-2221 号掲載) につ  
いては特許法第17条の2の規定による補正があっ  
たので下記のとおり掲載する。 3 ( 2 )

平成 1 年 6 月 5 日

特許庁長官 吉田 文蔵 殿

Int. Cl. 1	識別記号	庁内整理番号
A01N 43/36		7215-48

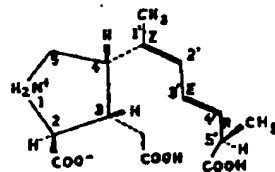
1. 事件の表示  
昭和57年特許願第105201号
2. 発明の名称  
殺虫剤
3. 補正をする者  
事件との関係 特許出願人  
住 所 大阪市北区堂島浜2丁目1番40号  
名 称 サントリー株式会社  
代表者 佐治 敏三
4. 代 理 人 532  
住 所 大阪府大阪市淀川区東三国1-32-12  
リビース新御堂606号  
氏 名 弁理士(6294) 門脇 清  
電話06-395-2714 / 06-391-6712 :  
06-397-1007(FAX)
5. 補正命令の日付  
なし(自発)
6. 補正により増加する発明の数 0

7. 補正の対象

(I) 明細書の「発明の詳細な説明」の欄

8. 補正の内容

(I) 明細書、1頁の下式(I)を下記の通りに改める。



(I)